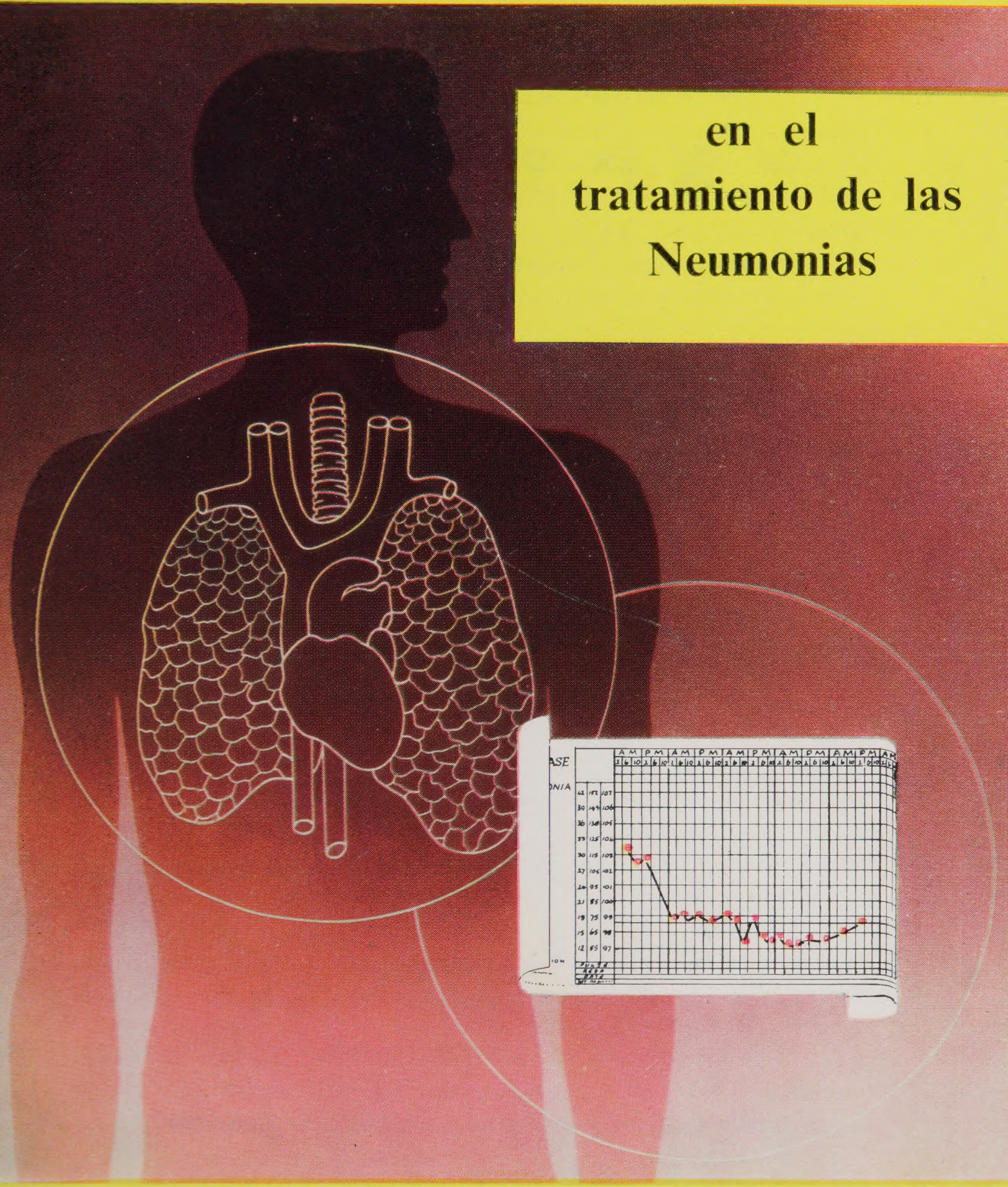
‘SULPHAMEZATHINE’

SULFADIMETILPIRIDINA

en el tratamiento de las Neumonias



IMPERIAL CHEMICAL (PHARMACEUTICALS) LTD

Compañía subsidiaria de la Imperial Chemical Industries Ltd.

WILMSLOW, MANCHESTER INGLATERRA

Editado exclusivamente para los señores médicos

'SULPHAMEZATHINE'

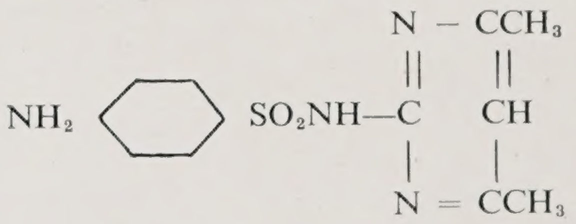
para
el tratamiento
de las

NEUMONIAS

Existen actualmente pruebas suficientes para demostrar que la ' Sulphamezathine ' es la sulfonamida de elección en el tratamiento de las neumonias. Mediante ella se logra dominar rápidamente la infección, con un mínimo de efectos tóxicos secundarios, y ha sido designada por muchos médicos como el medicamento de preferencia para las personas de todas las edades, especialmente para los lactantes y los niños de pocos años.

Propiedades

La ' Sulphamezathine ' es la pirimidina 2-(*p*-aminobencenosulfonamido)-4:6 dimetil (Sulfadimetilpirimidina B.P.C.). Es un derivado de la sulfadiazina y tiene la siguiente fórmula estructural:



Químicamente, la ' Sulphamezathine ' es muy estable y se presenta como un polvo blanco y cristalino, fusible a los 197° C. Es soluble en agua y esta solubilidad corresponde a la proporción de 93 miligramos por 100 c.c. a 37° C. La ' Sulphamezathine ' sódica es una sal soluble que se prepara en solución acuosa estéril, para administración parenteral.

Caracteristicas

Diversas cualidades especiales de la 'Sulphamezathine' hacen que sea la sulfonamida ideal para el tratamiento de las neumonias. Se ha demostrado que es màs eficaz que la sulfapiridina, el sulfatiazol o la sulfadiazina (Loughlin y cols.—1943). Es absorbida con rapidez, lo que proporciona pronto un alto nivel de la droga en sangre, y como se elimina con relativa lentitud, su proporción en el torrente circulatorio puede mantenerse fácil y con-

22503514177
WELLCOME
LIBRARY
P 11860

venientemente. Tanto la ' Sulphamezathine ' como sus derivados acetílicos son fácilmente solubles, especialmente hacia el lado ácido de la neutralidad, de forma que las posibilidades de complicaciones urinarias son mínimas. En una revisión de los efectos tóxicos de las sulfonamidas, Luxton (1947) puntualizó que la ' Sulphamezathine ' se ha reconocido como la menos tóxica de todas, pero de igual eficacia que cualquiera de ellas. En más de mil casos tratados con ' Sulphamezathine,' no se produjo ni un solo caso de muerte debido a la droga, y considera que la ' Sulphamezathine ' es la más segura y potente de todas las sulfonamidas.

Hawking (1948), en una revisión de los principios que regulan la elección de las sulfonamidas y de las más destacadas características de las de uso corriente, ha declarado que la ' Sulphamezathine ' es una de las menos tóxicas y, probablemente, la mejor para su empleo general. Asegura que la ' Sulphamezathine ' es más soluble que la sulfadiazina, no causa bloques urinario y proporciona concentraciones mas elevadas en sangre. Este autor tambien coloca la ' Sulphamezathine ' en el lugar de preferencia para el tratamiento de las neumonias.

Su valor en la Neumonia

Como tratamiento sistemático para la neumonia lobar—que en la gran mayoría de los casos es producida por gérmenes sulfamido-sensibles (70-90% pneumococos)—la ' Sulphamezathine ' puede suministrarnos con toda seguridad un alto porcentaje de satisfactorios resultados.

También posee un valor análogo, aunque en menor grado, para el tratamiento de la bronconeumonia o neumonia lobular. En este proceso, la infección es debida frecuentemente a una amplia variedad de agentes microbianos, entre los que existen algunos parcial o totalmente resistentes a las sulfamidas. Este es el caso particular de las bronconeumonias secundarias a otros procesos febriles agudos, de carácter específico, tales como el sarampión, tos ferina o influenza, y de las que aparecen en la debilidad infantil o en la edad avanzada. En las neumonias por aspiración o deglución, la ' Sulphamezathine ' debe ser administrada como en la lobar o en la bronconeumonia, a fin de detener la infección mientras se ponen en práctica otros medios de tratamiento—como el postural, etc.—, si se consideran necesarios.

La neumonia primaria atípica (virus pneumonia) no responde a la sulfamidoterapia (Dingle y colaboradores, 1944).

Tratamiento Combinado con Penicilina

La cuestión acerca de cuál de los dos elementos, sulfamidas ó penicilina es más activo en el tratamiento de la neumonia neumocócica, no ha sido

finalmente resuelta; esta acción ha sido descrita por varios autores, como muy similar. Se ha sugerido que ciertos pacientes en peligro inminente de sufrir una neumonia, deben ser tratados desde un principio mediante una combinación de ambos medicamentos. Están incluidos en este grupo aquellos enfermos que tienen más de 40 años de edad, que presentan leucopenia en vez de la leucocitosis habitual, y muestran una tendencia progresiva al proceso neumónico, y los que el cultivo de la sangre revela una bacteriemia. La penicilina también está indicada en los casos que se compruebe son resistentes a las sulfamidas, ó en los que el examen del esputo demuestra la existencia de un organismo—como es el estafilococo—que se sabe posee una mejor respuesta a la acción de aquel antibiótico que a la de este.

Informes Clinicos

En las experiencias primitivas, Macartney y cols. (1942) utilizaron ' Sulphamezathine ' en 73 casos de neumonia lobar. La mejoría clínica se produjo en las primeras 24 horas de haberse comenzado el tratamiento. No se observaron casos de cianosis, ni depresión física o mental, y las náuseas y vómitos que aparecieron en unos pocos casos, no fueron incompatibles con el tratamiento. La proporción de mortalidad fué del 3% en los enfermos de menos de 40 años, y del 11% en los de edad superior.

Jennings y Patterson (1942) realizaron ensayos con ' Sulphamezathine ' en los niños. Se obtuvieron buenos resultados en casos de neumonia lobar y de bronconeumonia. Se alcanzaron con seguridad elevados niveles de la droga en sangre y fué bien tolerada por los niños de todas las edades.

Morgan y Wylie Smith (1943), en una serie de 137 casos, trataron enfermos alternativamente con ' Sulphamezathine ' y sulfadiazina, comparando los resultados con los de una serie de 354 tratados con sulfapiridina. La eficacia curativa de la ' Sulphamezathine,' como la estimación de la mortalidad, se comprobó que al menos era igual que las de la sulfadiazina, y que ambas drogas se podían comparar favorablemente con la sulfapiridina. La incidencia de fenómenos tóxicos fué del 6% con ' Sulphamezathine ' y 7% con sulfadiazina, frente al 52% que produjo la sulfapiridina. Con ' Sulphamezathine ' no se observaron trastornos gastro-intestinales ni oliguria. El tiempo medio requerido para que se normalizara la temperatura fué 43 horas para la ' Sulphamezathine,' 35 horas para la sulfadiazina, y 29 para la sulfapiridina. En la serie tratada con ' Sulphamezathine ' no hubo casos de muerte ni de bacteriemia. En la tratada con sulfadiazina se produjeron dos muertes y tres casos pre-

sentaron bacteriemia; en los tratados con sulfapiridina la mortalidad fué de 7,9%.

En una serie de 134 casos, Melton (1944) confirmó que la ' Sulphamezathine ' resulta altamente satisfactoria en el tratamiento de la neumonia lobar. La mortalidad proporcional fué más baja que en una serie paralela de enfermos tratados con sulfapiridina y expresa la opinión de que la menor toxicidad de la ' Sulphamezathine ' debe ayudar a reducir la mortalidad de los pacientes, en tanto que la ausencia virtual de vómitos garantiza una absorción más completa del medicamento. Se confirmo la rareza de complicaciones urinarias y de cianosis con el empleo de esta droga.

En 27 casos de neumonia infantil tratados con ' Sulphamezathine,' King Lewis (1944) comprobó que la proporción de mortalidad (3,7%) fué considerablemente más baja que la experimentada en series comparables de casos tratados con sulfadiazina (11,5%) y sulfapiridina (9,9%). Se utilizaron dosis diarias de 3-4 gramos para el grupo de edad 1½-3 años, 4-6 gramos diarios para el de 3-5 años, y 6-8 gramos para el de 6-10 años; las dos primeras dosis fueron dobles y administradas con un intervalo de tres horas, y las normales, de mantenimiento, con intervalos de seis horas. Ramsay y colaboradores (1945), que trataron 287 casos de neumonía neumocócica, tambien alcanzaron favorables resultados con ' Sulphamezathine.' La mortalidad total en sus casos fué 8,4%, pero de los 24 fallecidos, 22 tenían más de 50 años. En el grupo de edad por debajo de los 50 años (184 casos), la mortalidad fué solo de 2,5%.

Henderson y Couper (1946) emplearon ' Sulphamezathine ' en el tratamiento de 35 casos de neumonia y bronconeumonia infantiles, y obtuvieron una mortalidad más baja que la de varias series paralalas tratadas con otras sulfonamidas. Se alcanzaron resultados rápidos y satisfactorios, y los autores consideran la ' Sulphamezathine ' como la droga de elección para la neumonia y la bronconeumonia.

Scadding (1946), discutiendo el tratamiento de la neumonia mediante medicamentos sulfamídicos, defendió el sulfatiazol, la sulfadiazina y la ' Sulphamezathine ' como los menos propensos a determinar náuseas y vómitos. Sin embargo, él comunicó más adelante que los dos primeros preparados son más aptos que el último para originar complicaciones renales y, por tanto, es preferible el tratamiento sistemático con ' Sulphamezathine.' Por esta misma razón, el autor señalaba que las precauciones habituales acerca de la ingestión de líquidos y alcalinización de la orina, son menos importantes cuando se emplea la ' Sulphamezathine ' que sí usamos otras sulfamidas.

PRESENTACION

‘ Sulphamezathine,’ Polvo

Envases de ... ... 25, 100 y 500 gramos

‘ Sulphamezathine,’ Tabletas

de 0,5 gramos

Para administración oral

Envases de ... ... 25, 100, 500 y 5.000

‘ Sulphamezathine ’ en Suspension Oral

En la proporción de 1 *gramos por* 7 *c.c.*

Frascos de ... ... 100 c.c., 500 c.c. y 2 litros

‘ Sulphamezathine ’ Sodica

Solución estéril al $33\frac{1}{3}\%$ *para administración parenteral*

Ampollas de ... 3 c.c. (1 gramo) y 9 c.c. (3 gramos)

Cajas de ... ... 5 y 25 ampollas

IMPERIAL CHEMICAL (PHARMACEUTICALS) LTD

Compañía subsidiaria de la Imperial Chemical Industries Ltd.

WILMSLOW, MANCHESTER INGLATERRA

Impreso en Inglaterra *SPM-MA-L-S/318/253/549*

1950